

⑫ 公表特許公報 (A)

平3-501025

⑬ 公表 平成3年(1991)3月7日

⑭ Int.Cl.¹
A 61 K 31/557識別記号
ABL
ABV府内整理番号
7252-4C審査請求
子備審査請求未請求
未請求

部門(区分) 3 (2)

(全 11 頁)

⑮ 発明の名称 緑内障または眼圧亢進の治療のためのプロスタグラジン誘導体

⑯ 特 願 平1-509228

⑭ 類似文提出日 平2(1990)5月2日

⑯ 出 願 平1(1989)9月6日

⑭ 國際出願 PCT/SE89/00475

⑭ 國際公開番号 WO90/02553

⑭ 國際公開日 平2(1990)3月22日

優先権主張 ⑮ 1988年9月6日 ⑯ スウェーデン(S E)⑭ 8803110-9

⑮ 1988年10月28日 ⑯ スウェーデン(S E)⑭ 8803855-9

⑯ 発明者 シエルンシャンツ、ヨハン・ド スウェーデン国エス-752 38 ウブサラ、ヴィツラヴエイエン
ウツベルトヴェー 1ペー⑯ 発明者 レスル、バーラム スウェーデン国エス-754 49 ウブサラ、ヴィートコールスガタ
ン112

⑯ 出願人 フアーマシア・アクチエボラード スウェーデン国エス-751 82 ウブサラ (番地なし)

⑯ 代理人 弁理士 高木 千嘉 外2名
⑯ 指定国 AU, DK, FI, JP, NO, US

請求の範囲

1) オメガ鎖は下記式:



(式中、Cは炭素原子(数はカッコ内に表示)であり、
Bは単結合、二重結合または三重結合であり、
Dは炭素原子1~10個の鎖であるが、場合によりヘテロ原子O、SまたはNで中断されていてよく、各炭素原子の変換基はH、アルキル基、疎ましくは炭素原子1~5個の低級アルキル基、カルボニル基、またはヒドロキシル基であり、

R₁はフェニル基のような環構造であり、未置換であるか、またはC₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁~C₄脂肪族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、およびフェニル基から選択される炭素基の少なくとも1つを有するもの: または、環原子5~8個を有する芳香族ヘテロ環基、例えばテアゾール、イミダゾール、ピロリジン、チオベンおよびオキサゾール; または環内に炭素原子3~7個を有するシクロアルカジンまたはシクロアルケン、ただし、場合により炭素原子1~5個の低級アルキル基で置換されているものである)

の構造を有する、プロスタグラジン誘導体がPGA、PGB、PGD、PGEまたはPGFの、治療活性があり生理学的に許容される誘導体の、緑内障または眼圧亢進の治療の為の眼科

用組成物の製製のための使用。

2) 式中、Dが炭素原子2~8個を有する鎖である請求項1記載の使用。

3) 式中、Dが炭素原子2~5個を有する鎖である請求項1記載の使用。

4) 式中、Dが炭素原子3個を有する鎖である請求項1記載の使用。

5) 式中、Bが単結合または二重結合であり、C₁~C₄上の置換基がカルボニル基または(R)-OHまたは(S)-OHである請求項1~4のいずれか1項に記載の使用。6) 式中、R₂がフェニル基ただし未置換であるかまたはC₁~C₄アルキル基、C₁~C₄アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁~C₄脂肪族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子またはフェニル基から選択される炭素基の少なくとも1つを有するものである請求項1~5のいずれか1項に記載の使用。

7) プロスタグラジン誘導体が17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体である請求項6記載の使用。

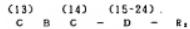
8) プロスタグラジン誘導体が15-デヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体または13,14-ジヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体である請求項7記載の使用。

9) プロスタグラジン誘導体がPGA、PGEまたはPGFの13,14-ジヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類縁体である請求項8記載の使用。

10) プロステグランジンがPGC、PGEまたはPGFの15-デヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル誘導体である請求項8記載の使用。

11) プロステグランジン誘導体がアルキルエステルである請求項1-10のいずれか1項に記載の使用。

12) オメガ鎖が下記式：



(式中、Cは炭素原子(数はカッコ内に表示)であり、Bは単結合、二重結合または三重結合であり、Dは炭素原子1～10個の鎖であるが、場合によりテロ原子O、SまたはNで中断されていてよく、各炭素原子上の置換基はH、アルキル基、好ましくは炭素原子1～5個の低級アルキル基、カルボニル基、またはヒドロキシル基であり、R₁はフェニル基のような置換基であり、未置換であるか、またはC₁～C₅アルキル基、C₁～C₅アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁～C₅置換族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、およびエニル基から選択される置換基の少なくとも1つを有するもの；または、複原子5～6個を有する芳香族テロ基、例えばチアゾール、イミダゾール、ピロリジン、チオベンオおよびオキサゾール；または側内に炭素原子3～7個を有するシクロアルカンまたはシクロアルケン、ただし、場合により炭素原子1～5個の低級アルキル基で置換

されているものである)の構造を有する、プロステグランジンPGC、PGB、PGD、PGEまたはPGFの、治療活性があり生物学的に評価される誘導体の、限界低下有効量と限界の表面を接触させることからなる、対象の臓の臓内液または臓元液を治療する方法。

13) 式中、Dが炭素原子2～6個を有する鎖である請求項12記載の方法。

14) 式中、Dが炭素原子2～5個を有する鎖である請求項12記載の方法。

15) 式中、Dが炭素原子3個を有する鎖である請求項12記載の方法。

16) 式中、Bが単結合または二重結合であり、C₁上の置換基がカルボニル基または(R)₂-ORまたは(S)-OHである請求項12～15のいずれか1項に記載の方法。

17) 式中、R₁がフェニル基、ただし未置換であるかまたはC₁～C₅アルキル基、C₁～C₅アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁～C₅置換族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子またはエニル基から選択される置換基の少なくとも1つを有するものである請求項12～16のいずれか1項に記載の方法。

18) プロステグランジン誘導体が17-フェニル-18,19,20-トリノル類似体である請求項17記載の方法。

19) プロステグランジン誘導体が15-デヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類似体または13,14-ジ

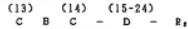
ヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類似体である請求項18記載の方法。

20) プロステグランジン誘導体がPGC、PGEまたはPGFの15-デヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類似体である請求項19記載の方法。

21) プロステグランジンがPGC、PGEまたはPGFの13,14-ジヒドロ-17-フェニル-18,19,20-トリノル類似体である請求項20記載の方法。

22) プロステグランジン誘導体がアルキルエステルである請求項12-21のいずれか1項に記載の方法。

23) オメガ鎖が下記式：



(式中、Cは炭素原子(数はカッコ内に表示)であり、Bは単結合、二重結合または三重結合であり、Dは炭素原子1～10個の鎖であるが、場合によりテロ原子O、SまたはNで中断されていてよく、各炭素原子上の置換基はH、アルキル基、好ましくは炭素原子1～5個の低級アルキル基、カルボニル基、またはヒドロキシル基であり、R₁はフェニル基のような置換基であり、未置換であるか、またはC₁～C₅アルキル基、C₁～C₅アルコキシ基、トリフルオロメチル基、C₁～C₅置換族アシルアミノ基、ニトロ基、ハロゲン原子、およびエニル基から選択される置換基の少なくとも1つを有するもの；または、

炭素原子5～6個を有する芳香族テロ基、例えばチアゾール、イミダゾール、ピロリジン、チオベンオおよびオキサゾール；または側内に炭素原子3～7個を有するシクロアルカンまたはシクロアルケン、ただし、場合により炭素原子1～5個の低級アルキル基で置換されているものである)の構造を有する、プロステグランジンPGC、PGB、PGD、PGEまたはPGFの、治療活性があり生物学的に評価される誘導体の、限界低下有効量と限界の表面を接触させることからなる、対象の臓の臓内液または臓元液を治療するための臓用組成物。